

鎮咳去痰剤

貯 法：室温保存
有効期間：5年デキストロメトルフアン臭化水素酸塩水和物・
クレゾールスルホン酸カリウムシロップ

承認番号 22100AMX00720000

販売開始 1956年10月

メジコン®
MEDICON® Combination Syrup

2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者

3. 組成・性状

3.1 組成

販売名	メジコン配合シロップ
有効成分	1mL中 デキストロメトルフアン臭化水素酸塩水和物 2.5mg クレゾールスルホン酸カリウム 15mg
添加剤	エタノール、白糖、カラメル、安息香酸、水酸化ナトリウム、チェリーエッセンス（安息香酸ベンジル、エチルバニリン、グリセリン、バニリン、香料）

3.2 製剤の性状

販売名	メジコン配合シロップ
性状・剤形	淡黄褐色澄明の粘稠な液体である。（シロップ剤）
pH	3.3~4.5

4. 効能・効果

下記疾患に伴う咳嗽及び喀痰喀出困難

急性気管支炎、慢性気管支炎、感冒・上気道炎、肺結核、百日咳

6. 用法・用量

通常、成人には1日18~24mL、8~14歳1日9~16mL、3ヵ月~7歳1日3~8mLを3~4回に分割経口投与する。

なお、年齢、症状により適宜増減する。

8. 重要な基本的注意

眠気を催すことがあるので、本剤投与中の患者には自動車の運転等危険を伴う機械の操作に従事させないように注意すること。

9. 特定の背景を有する患者に関する注意

9.5 妊婦

妊婦又は妊娠している可能性のある女性には、治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。

9.6 授乳婦

治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。

9.8 高齢者

減量するなど注意すること。一般に生理機能が低下している。

10. 相互作用

本剤は、主に肝代謝酵素 CYP2D6 で代謝される。[16.4 参照]

10.2 併用注意（併用に注意すること）

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
選択的 MAO-B 阻害剤 セレギリン塩酸塩 ラサギリンメシル酸塩 サフィナミドメシル酸塩	セロトニン症候群があらわれることがある。	本剤及びこれらの薬剤は脳内のセロトニン濃度を上昇させる作用を有するため、併用によりセロトニンの濃度が更に高くなるおそれがある。

薬剤名等	臨床症状・措置方法	機序・危険因子
薬物代謝酵素（CYP2D6）を阻害する薬剤 キニジン アミオダロン テルピナフィン等	本剤の血中濃度が上昇することがある。	これらの薬剤の薬物代謝酵素（CYP2D6）阻害作用により、本剤の代謝が阻害されるため。
セロトニン作用薬 選択的セロトニン再取り込み阻害剤（SSRI）等	セロトニン症候群等のセロトニン作用による症状があらわれることがある。	セロトニン作用が増強するおそれがある。

11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

11.1 重大な副作用

11.1.1 呼吸抑制（頻度不明）

11.1.2 ショック、アナフィラキシー（いずれも頻度不明）

呼吸困難、蕁麻疹、血管浮腫等の異常が認められた場合には投与を中止し、適切な処置を行うこと。

11.2 その他の副作用

種類\頻度	0.1~5%未満	頻度不明
過敏症		発疹
精神神経系		眠気、頭痛、眩暈、不快、不眠
消化器	悪心・嘔吐、食欲不振、軟便、下痢	便秘、腹痛、口渇、おくび

13. 過量投与

13.1 症状

嘔気、嘔吐、尿閉、運動失調、錯乱、興奮、神経過敏、幻覚、呼吸抑制、嗜眠等を起こすことがある。

13.2 処置

ナロキソンの投与により改善したとの報告がある。

16. 薬物動態

16.1 血中濃度

咳嗽を伴う成人気管支炎患者8例にデキストロメトルフアン臭化水素酸塩シロップ60mg^注を単回経口投与したときの薬物動態パラメータを表16-1に示す¹⁾（外国人データ）。

表16-1 薬物動態パラメータ

投与量 (mg)	例数	Cmax* ¹ (ng/mL)	Tmax* ² (hr)	AUC _{0-∞} * ¹ (ng・hr/mL)	T _{1/2} * ¹ (hr)
60	8	386±107.2	2.0 (1.0-2.0)	2169±702.6	3.3±0.63

※1：平均値±標準偏差

※2：中央値（範囲）

（測定法：GC/MS）

イヌにデキストロメトルフアン臭化水素酸塩水和物15mg及びクレゾールスルホン酸カリウム90mgを経口投与したときのデキストロメトルフアン及び4-クレゾールスルホン酸の薬物動態パラメータ²⁾を表16-2に示す。

表 16-2 薬物動態パラメータ

	例数	Cmax (ng/mL)	Tmax (hr)	AUC (ng・hr/mL)
デキストロメトルファン	6	3.33	1.50	AUC ₀₋₇ 12.796
4-クレゾールスルホン酸	6	6050	0.75	AUC ₀₋₃ 8820

(平均値)

注) 本剤の承認された成人の用法用量は、1日 18~24mL (デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物として 45~60mg) を 3~4回に分割経口投与である。

本剤はデキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物とクレゾールスルホン酸カリウムの配合剤である。

16.4 代謝

デキストロメトルファンは肝臓で大部分が代謝され、*O*-脱メチル体 (デキストルファン)、*N*-脱メチル体及び *N*、*O*-脱メチル体となる。これらの代謝物はデキストロメトルファンと同等の鎮咳作用を示した³⁾ (外国人データ)。

デキストロメトルファンの肝代謝に関する CYP 分子種は、*O*-脱メチル化では CYP2D6、*N*-脱メチル化では CYP3A4 である⁴⁾。

[10参照]

16.5 排泄

ヒトに ¹⁴C-標識デキストロメトルファンを経口投与したとき、投与後 24 時間以内の尿中及び糞中回収率は、総投与放射活性に対してそれぞれ 42.71%、0.12%であった⁵⁾ (外国人データ)。

17. 臨床成績

17.1 有効性及び安全性に関する試験

17.1.1 国内臨床試験

再評価時の臨床試験の成績は以下のとおりであった⁶⁾。

表 17-1 臨床成績

疾患名	有効例数/有効性評価対象例数	有効率 (%)
急性気管支炎	4/11	36.4
慢性気管支炎	17/25	68.0
慢性細気管支炎	0/1	-
感冒	31/48	64.6
計	52/85	61.2

18. 薬効薬理

18.1 作用機序

18.1.1 デキストロメトルファンは延髄にある咳中枢に直接作用し、咳反射を抑制することにより鎮咳作用を示す⁷⁾。

18.1.2 クレゾールスルホン酸カリウムはウサギを用いた試験によれば気道の分泌を促進し、粘稠な喀痰を液化して去痰作用を示す⁸⁾。

19. 有効成分に関する理化学的知見

19.1 デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物

一般的名称：デキストロメトルファン臭化水素酸塩水和物
(Dextromethorphan Hydrobromide Hydrate)
(JAN) [日局]

化学名：(9*S*,13*S*,14*S*)-3-Methoxy-17-methylmorphinan
monohydrobromide monohydrate

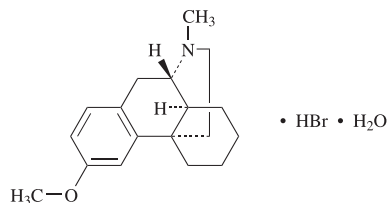
分子式：C₁₈H₂₅NO・HBr・H₂O

分子量：370.32

性状：白色の結晶又は結晶性の粉末である。

メタノールに極めて溶けやすく、エタノール (95) 又は酢酸 (100) に溶けやすく、水にやや溶けにくい。

化学構造式：



融点：約 126℃

分配係数：16.98 [pH7、1-オクタノール/緩衝液]

19.2 クレゾールスルホン酸カリウム

一般的名称：クレゾールスルホン酸カリウム

(Potassium Cresolsulphonate) (JAN) [局外規]

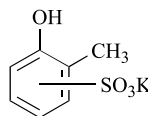
分子式：C₇H₇KO₄S

分子量：226.29

性状：白色の結晶性の粉末で、においはなく、味は苦い。

水又はギ酸に溶けやすく、エタノール (95) にやや溶けにくく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。

化学構造式：



20. 取扱い上の注意

光により退色するので、外箱開封後は遮光して保存すること。

22. 包装

500mL [瓶]

23. 主要文献

[文献請求番号]

- 1) Aylward, M. et al. : Eur. J. Respir. Dis. 1984; 65: 283-291 [198402875]
- 2) 社内資料: イヌでのバイオアベイラビリティ [197600807]
- 3) Willner, K. et al. : Arzneim.-Forsch. 1963; 13: 26-29 [196300035]
- 4) 野口英世: 薬物動態. 1995; 10: 407-412 [199500744]
- 5) Calesnick, B. et al. : Clin. Pharmacol. Ther. 1967; 8: 374-380 [196700073]
- 6) 社内資料: 鎮咳去痰剤メジコンシロップの使用経験 [202100142]
- 7) 谷山紘太郎ほか: NEW 薬理学 (田中千賀子ほか編). 東京: 南江堂; 2002. p442-445
- 8) 大谷弘一ほか: 薬理と治療. 1977; 5: 1513-1516 [197700302]

24. 文献請求先及び問い合わせ先

塩野義製薬株式会社 医薬情報センター

〒541-0045 大阪市中央区道修町 3 丁目 1 番 8 号

電話 0120-956-734

FAX 06-6202-1541

<https://med.shionogi.co.jp/>

26. 製造販売業者等

26.1 製造販売元

シオノギファーマ株式会社

大阪府摂津市三島 2 丁目 5 番 1 号

26.2 販売元

塩野義製薬株式会社

大阪市中央区道修町 3 丁目 1 番 8 号